

**Translation**

**PATENT COOPERATION TREATY**

PCT/EP2003/012774



**PCT**

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY**  
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 54063	<b>FOR FURTHER ACTION</b> See Form PCT/IPEA/416	
International application No. PCT/EP2003/012774	International filing date (day/month/year) 14 November 2003 (14.11.2003)	Priority date (day/month/year) 15 November 2002 (15.11.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 487/04		
Applicant BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

<p>1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.</p> <p>2. This REPORT consists of a total of <u>4</u> sheets, including this cover sheet.</p> <p>3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:</p> <p>a. <input type="checkbox"/> (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of _____ sheets, as follows:</p> <p><input type="checkbox"/> sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).</p> <p><input type="checkbox"/> sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) _____, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).</p>	
<p>4. This report contains indications relating to the following items:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. I Basis of the report</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. II Priority</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. IV Lack of unity of invention</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VI Certain documents cited</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VII Certain defects in the international application</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VIII Certain observations on the international application</p>	

Date of submission of the demand 14 May 2004 (14.05.2004)	Date of completion of this report 08 February 2005 (08.02.2005)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

EP2003/012774

## Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

☐ This report is based on translations from the original language into the following language \_\_\_\_\_, which is language of a translation furnished for the purpose of:

- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))  
☐ publication of the international application (under Rule 12.4)  
☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

☒ The international application as originally filed/furnished

☒ the description:

pages \_\_\_\_\_ 1-41 \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

☒ the claims:

pages \_\_\_\_\_ 1-14 \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement) under Article 19

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

☐ the drawings:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

☐ the description, pages \_\_\_\_\_

☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_

☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_

☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

☐ the description, pages \_\_\_\_\_

☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_

☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_

☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

\* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT 03/12774

## V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-14 (all in part)	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-14 (all in part)	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-14 (all in part)	YES
	Claims		NO

## 2. Citations and explanations

1. Since the applicant has not paid any further fees, this opinion applies only to the compounds in which X is bound to the ring by a carbon atom.

2. The following documents are available as the closest prior art:

D1: WO 02/088127 A (BAYER) 7 November 2002  
(2002-11-07)

D2: WO 02/088126 A (BAYER) 7 November 2002  
(2002-11-07)

3. Novelty over D1 and D2 is acknowledged, since the substituent X in the D1 and D2 compounds is always halogen.

4. D1 is the closest prior art. Said document describes compounds which can also be used against undesirable micro-organisms.

The problem addressed is considered that of providing further triazolopyrimidine derivatives that can control undesirable micro-organisms.

In view of the data given in the description, this problem is considered to be solved.

Although there is nothing in either D1 or D2 to induce a person skilled in the art to replace the halogen atom bound to the 5-position of the triazolopyrimidine ring by an optionally substituted alkyl chain and thereby to arrive at the compounds according to the invention, an inventive step cannot be acknowledged in respect of the whole scope claimed.

It is not clear from the teachings of D1 and/or D2 and from the content of the description why the claimed generalisation would be obvious to a person skilled in the art if the mere replacement of a halogen atom by a carbon atom is to be regarded as inventive.

An inventive step is therefore not acknowledged in respect of the whole scope.

5. Industrial applicability is established.

# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT PCT (Artikel 36 und Regel 70 PCT)

REC'D 10 FEB 2005

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 5/063	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/PEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/12774	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 14.11.2003	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 15.11.2002
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D487/04		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.



2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 4 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Bescheids
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☒ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags  14.05.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  08.02.2005
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde   Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter  Ousset, J-B Tel. +49 89 2399-8271 

**I. Grundlage des Berichts**

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):

**Beschreibung, Seiten**

1-41 in der ursprünglich eingereichten Fassung

**Ansprüche, Nr.**

1-14 in der ursprünglich eingereichten Fassung

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um:

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung, Seiten:
- ☐ Ansprüche, Nr.:
- ☐ Zeichnungen, Blatt:

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

**IV. Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung**

1. Auf die Aufforderung zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren hat der Anmelder:
  - ☐ die Ansprüche eingeschränkt.
  - ☐ zusätzliche Gebühren entrichtet.
  - ☐ zusätzliche Gebühren unter Widerspruch entrichtet.
  - ☒ weder die Ansprüche eingeschränkt noch zusätzliche Gebühren entrichtet.
2. ☐ Die Behörde hat festgestellt, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist, und hat gemäß Regel 68.1 beschlossen, den Anmelder nicht zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren aufzufordern.
3. Die Behörde ist der Auffassung, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nach den Regeln 13.1, 13.2 und 13.3
  - ☐ erfüllt ist.
  - ☐ aus folgenden Gründen nicht erfüllt ist:
4. Daher wurde zur Erstellung dieses Berichts eine internationale vorläufige Prüfung für folgende Teile der internationalen Anmeldung durchgeführt:
  - ☐ alle Teile.
  - ☒ die Teile, die sich auf die Ansprüche Nr. 1-14 (alle teilweise) beziehen.

**V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

1. Feststellung
  - Neuheit (N) Ja: Ansprüche 1-14(alle teilweise)
  - Nein: Ansprüche
  - Erfinderische Tätigkeit (IS) Ja: Ansprüche
  - Nein: Ansprüche 1-14(alle teilweise)
  - Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) Ja: Ansprüche 1-14(alle teilweise)
  - Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

**siehe Beiblatt**

**SECTION V**

1). Da die Anmelderin keine weiteren Gebühren bezahlt hat, gilt dieses Gutachten lediglich für die Verbindungen, in denen X durch ein Kohlenstoffatom am Ring gebunden ist.

2). Folgende Dokumente stehen als nächstliegender Stand der Technik zur Verfügung:

D1: WO 02/088127 A (BAYER) 7. November 2002 (2002-11-07)

D2: WO 02/088126 A (BAYER) 7. November 2002 (2002-11-07)

3). Neuheit gegenüber D1 und D2 wird anerkannt, da der Substituent X in den Verbindungen von D1 und D2 immer Halogen darstellt.

4). D1 stellt den nächstliegenden Stand der Technik dar. Dieses Dokument beschreibt Verbindungen, die auch gegen unerwünschte Mikroorganismen einsetzbar sind.

Die zu lösende Aufgabe wird darin gesehen, weitere Triazolopyrimidinderivate bereitzustellen, die unerwünschte Mikroorganismen bekämpfen können.

Angesichts der in der Beschreibung angegebenen Daten wird die Aufgabe als gelöst angesehen.

Obwohl der Fachmann weder in D1 noch in D2 irgendeine Veranlassung finden kann, um das an der Stelle 5 des Triazolopyrimidinrings gebundene Halogenatom durch eine gegebenenfalls substituierte Alkylkette zu ersetzen und dadurch zu den erfindungsgemäßen Verbindungen zu gelangen, kann eine erfinderische Tätigkeit für den ganzen beanspruchten Umfang nicht anerkannt werden.

Aus den Lehren von D1 und/oder D2 und aus dem Inhalt der Beschreibung ist es nicht ersichtlich, aus welchem Grund die beanspruchte Verallgemeinerung für den Fachmann naheliegend wäre, wenn der bloße Ersatz eines Halogenatoms durch ein Kohlenstoffatom als erfinderisch zu betrachten ist.

Eine erfindende Tätigkeit ist daher für den gesamten Umfang nicht anerkannt.

5). Es gibt keinen Einwand hinsichtlich der gewerblichen Anwendbarkeit.